

## PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 62-039563

(43)Date of publication of application : 20.02.1987

(51)Int.Cl.

C07C145/00  
 A01N 33/20  
 A01N 37/10  
 A01N 37/40  
 A01N 43/54  
 A01N 47/06  
 A01N 47/12  
 C07C149/273  
 C07C154/00  
 C07C161/00  
 C07D239/38  
 C07F 7/18

(21)Application number : 60-176997

(71)Applicant : HOKKO CHEM IND CO LTD  
 UBE IND LTD

(22)Date of filing : 13.08.1985

(72)Inventor : HIROTA YOJIRO  
 TSUJIMOTO KAZUYUKI  
 WADA TAKUO  
 IDE HARUO

(54) BETA-NITROPHENETHYL DERIVATIVE AND AGRICULTURAL AND HORTICULTURAL GERMICIDE

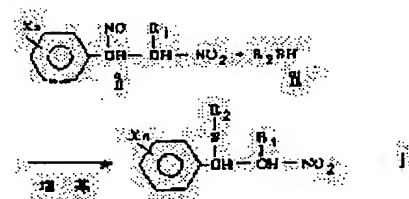
(57)Abstract:

NEW MATERIAL: A compound expressed by formula I [R<sub>1</sub> is H or lower alkyl; R<sub>2</sub> is alkyl, hydroxy, amino, alkoxy, carbonyl, phenyl, benzyl, naphthyl, etc.; X is H, halogen, hydroxyl, nitro, (halogen-substituted) lower alkyl, lower alkoxy, etc.; n is an integer 1W3].

EXAMPLE: 2-(p-Chlorophenylthio)2-phenyl-1-nitroethane.

USE: A safe agricultural and horticultural germicide effective for loose smut of wheat or barley, etc., and blast or rice plant, etc., when used as a seed disinfectant without toxicity to humans, animals and fishes.

PREPARATION: According to the reaction formula, a β-nitrosonitroethane expressed by formula II is reacted with a mercaptan expressed by formula III to afford the aimed β-nitrophenethyl derivative expressed by formula I.



## LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

⑩ 日本国特許庁(JP)

⑪ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報(A)

昭62-39563

⑬ Int. Cl.<sup>4</sup>

識別記号

庁内整理番号

⑭ 公開 昭和62年(1987)2月20日

C 07 C 145/00  
A 01 N 33/20  
37/10  
37/40  
43/54  
47/06  
47/12

1 0 2

7188-4H  
8519-4H  
8519-4H  
8519-4H  
7215-4H  
C-8519-4H  
A-8519-4H

※審査請求 未請求 発明の数 2 (全19頁)

⑮ 発明の名称  $\beta$ -ニトロフェネチル誘導体および農園芸用殺菌剤

⑯ 特 願 昭60-176997

⑰ 出 願 昭60(1985)8月13日

⑱ 発 明 者 広 田 洋 二 郎 東京都千代田区霞が関3丁目7番2号 宇部興産株式会社  
東京本社内

⑲ 発 明 者 辻 本 一 幸 厚木市温水1883番地の6

⑲ 発 明 者 和 田 拓 雄 秦野市曾屋684番地の11

⑲ 発 明 者 井 出 陽 郎 鎌倉市西御門2丁目3番19号

⑳ 出 願 人 北興化学工業株式会社 東京都中央区日本橋本石町4丁目2番地

㉑ 出 願 人 宇部興産株式会社 宇部市西本町1丁目12番32号

㉒ 代 理 人 弁理士 八木田 茂 外2名

最終頁に続く

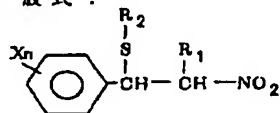
明 細 書

1. 発明の名称

$\beta$ -ニトロフェネチル誘導体および農園芸  
用殺菌剤

2. 特許請求の範囲

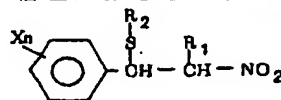
1. 一般式:



(式中、 $R_1$ は水素原子または低級アルキル基を表わし; $R_2$ はアルキル基、ヒドロキシ-、アミノ-、アルコキシカルボニル-、アルコキシカルボニルオキシ-、アルキルカルボニルオキシ-、トリフェニル-、ベンゾイルオキシ-、フェノキシカルボニルオキシ-またはトリ低級アルコキシシリル-置換低級アルキル基、ハロゲン、アミノ、アルキルおよびニトロ基から選んだ置換基で置換されていてもよいフェニル基、ハロゲンで置換されていてもよいベンジル基、ナフチル基、シクロヘキシル基、ピリミジニル基、N、N-ジ低級アルキル

チオカルバモイル基またはフェニル核上にハロゲンもしくは低級アルキル置換されていてもよいノ-フェニル 2-ニトロエタン-1-イル基を表わし; $X$ は水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、ハロゲン置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ジアルキルアミノ基またはハロゲン置換されていてもよいベンジルオキシ基を表わし; $n$ は1~3の整数を表わす)で示される $\beta$ -ニトロフェネチル誘導体。

2. 活性成分として、一般式:



(式中、 $R_1$ は水素原子または低級アルキル基を表わし; $R_2$ はアルキル基、ヒドロキシ-、アミノ-アルコキシカルボニル-、アルコキシカルボニルオキシ-、アルキルカルボニルオキシ-、トリフェニル-、ベンゾイルオキシ-、フェノキシカルボニルオキシ-またはトリ低級アルコキシシリル-

置換低級アルキル基、ハロゲン、アミノ、アルキルおよびニトロ基から選んだ置換基で置換されていてもよいフェニル基、ハロゲンで置換されていてもよいベンジル基、ナフチル基、シクロヘキシル基、ピリミジニル基、N, N-ジ低級アルキルチオカルバモイル基またはフェニル核上にハロゲンもしくは低級アルキル置換されていてもよいノ-フェニル 2-ニトロエタン-1-イル基を表わし；Xは水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、ハロゲン置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ジアルキルアミノ基またはハロゲン置換されていてもよいベンジロキシ基を表わし；nは1～3の整数を表わす）で示されるβ-ニトロフェネチル誘導体を含むことを特徴とする農園芸用殺菌剤。

### 3. 発明の詳細な説明

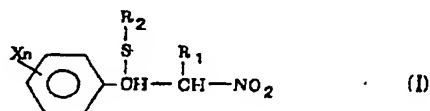
#### 産業上の利用分野

本発明は新規なβ-ニトロフェネチル誘導体及びそれを活性成分とする農園芸用殺菌剤に関する

害を示さないものでも、長年の施用等によつて土壌中に蓄積する結果、被害を発生する等の問題もある。このため、常に新しい農園芸用殺菌剤を開発、提供することが要望されている。

#### 問題点を解決するための手段、作用および効果

本発明者らは、上述したとき農園芸用殺菌剤の分野でかかえている諸問題を解決し得る新規な殺菌剤の開発を意図し、β-ニトロフェネチル系化合物に着目して多数のこの系の化合物を新規に合成し、それらについて農園芸分野での実用性を鋭意検討した。その結果、一般式(I)：



(式中、R<sub>1</sub>は水素原子または低級アルキル基を表わし；R<sub>2</sub>はアルキル基、ヒドロキシ-、アミノ-、アルコキシカルボニル-、アルコキシカルボニルオキシ-、アルキルカルボニルオキシ-、トリフェニル-、ベンゾイルオキシ-、フェノキシカルボ

ものである。

#### 従来の技術および問題点

従来β-ニトロフェネチル誘導体については医薬用殺菌剤、抗腫瘍剤としての生理活性を有することが知られている〔たとえば、ジャーナル オブ ジ アメリカン ケミカル ソサイエティ (J. Am. Chem. Soc.), 73, 142-5 (1951) 及び同誌, 77, 3860 (1955) 参照]が、農薬用としては殺菌活性の報告〔ケミカル アブストラクト, 60, 4061c (1966)〕があるのみで、農薬用殺菌剤としての有用性ないしその可能性についての報告は皆無である。

ところで、農園芸用殺菌剤として従来多数の化合物が知られたまたは実際に使用されているが、一つの化合物の使用ですべての植物病原菌の防除に有効であるわけではなく、抗菌スペクトラムは広狭さまざまであり、完全に満足できるとは限らない。また当初に有効であつた菌も耐性を獲得してこれに無効になる問題がある。さらに従来の殺菌剤化合物は被害を示すものもあり、また当初に薬

ニルオキシ-またはトリ低級アルコキシシリル-置換低級アルキル基、ハロゲン、アミノ、アルキルおよびニトロ基から選んだ置換基で置換されていてもよいフェニル基、ハロゲンで置換されていてもよいベンジル基、ナフチル基、シクロヘキシル基、ピリミジニル基、N, N-ジ低級アルキルチオカルバモイル基またはフェニル核上にハロゲンもしくは低級アルキル置換されていてもよいノ-フェニル 2-ニトロエタン-1-イル基を表わし；Xは水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、ハロゲン置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ジアルキルアミノ基またはハロゲン置換されていてもよいベンジロキシ基を表わし；nは1～3の整数を表わす）で示される新規β-ニトロフェネチル誘導体が農園芸用殺菌剤として予想外に優れた効力を示し、前記した諸問題の解決に有用であることを見出した。

したがつて、第1の本発明の要旨とするところは、前記一般式(I)で表わされ、特に農園芸用殺菌

剤として有用な新規  $\beta$ -ニトロフェネチル誘導体にある。







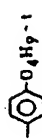
また第2の本発明の要旨とするところは、当該誘導体を活性成分として含有することを特徴とする農園芸用殺菌剤にある。

前記一般式(I)の定義において、アルキル基またはアルコキシ基について使用した用語「低級」は一般に1〜6個の炭素原子を含有することを示す。したがって、低級アルキル基の好ましい具体例は、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、*i*-ブチル、*tert*-ブチル、*n*-ペンチル、*n*-ヘキシル、*i*-ヘキシル基などを包含する。また低級アルコキシ基の好ましい具体例は、メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、*i*-プロポキシ、*n*-ブトキシ、*i*-ブトキシ、*sec*-ブトキシ、*tert*-ブトキシ、*n*-ペンチルオキシ基などを包含する。

つぎに本発明の  $\beta$ -ニトロフェネチル誘導体の代表例を第1表にその物性値とともに示す。これらの化合物の製造法の概要および具体例（実施例）






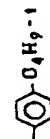

















は後述する。また化合物は後記の実施例および試験例においても参照される。


















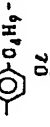






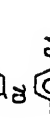

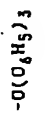


第1表

化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	X	物性値
1	H		H	$n_D^{22} 1.4316$
2	H	-O <sub>4</sub> H <sub>9</sub> - <i>n</i>	H	$n_D^{25} 1.3411$
3	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>4</sub> H <sub>9</sub> - <i>n</i>	H	$n_D^{25} 1.3174$
4	H		H	$n_D^{25} 1.3397$
5	H	-CH <sub>2</sub> OH <sub>2</sub> OH	H	$n_D^{25} 1.3666$
6	H	-O <sub>12</sub> H <sub>25</sub> - <i>n</i>	H	$n_D^{25} 1.3033$
7	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	$n_D^{27} 1.3339$
8	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>2</sub> H <sub>17</sub> - <i>i</i>	H	$n_D^{25} 1.3034$
9	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(O <sub>2</sub> H <sub>9</sub> - <i>n</i> )O <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	$n_D^{25} 1.3064$
10	H		H	mp. 108~111°C
11	H	-O <sub>3</sub> H <sub>7</sub> - <i>i</i>	H	$n_D^{25} 1.3414$
12	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> OC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ( <i>m, p</i> 混合)	$n_D^{25} 1.3349$
13	H	-O <sub>3</sub> H <sub>7</sub> - <i>i</i>	-CH <sub>2</sub> OC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ( <i>m, p</i> 混合)	$n_D^{25} 1.3379$
14	H		H	$n_D^{29} 1.3220$
15	H		H	$n_D^{28} 1.3389$
16	H		H	$n_D^{28} 1.3420$
17	H		H	mp. 71~73°C


























化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	X	物性値	化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	X	物性値
37	H		p-Br	<sup>24</sup> <sub>D</sub> 1.6391	18	H		H	<sup>15</sup> <sub>D</sub> 1.5801
38	H		H	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.5744	19	H		p-OL	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.6362
39	H		H	mp. 59~61°C	20	H		p-OL	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.5556
40	H		H	mp. 55~57°C	21	H		p-OL	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.5501
41	H		H	<sup>24</sup> <sub>D</sub> 1.5967	22	H		p-OL	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.5754
42	H		p-OL	mp. 55~57°C	23	H		p-OL	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.6044
43	H		p-OL	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.5754	24	H		p-OL	mp. 123~125°C
44	H		p-OL	mp. 124~126°C	25	H		p-OL	mp. 150~153°C
45	H		p-Br	mp. 55~58°C	26	H		p-OL	mp. 120~123°C
46	H		p-OL	<sup>24</sup> <sub>D</sub> 1.5542	27	H		p-OL	<sup>15</sup> <sub>D</sub> 1.5246
47	H		p-OL	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.6092	28	H		p-OL	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.6207
48	H		p-OL	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.6155	29	H		p-OL	<sup>21</sup> <sub>D</sub> 1.5275
49	H		p-OL	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.5855	30	H		p-OL	mp. 61~63°C
50	H		p-OL	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.6070	31	H		-OH <sub>2</sub> OL(m, p混合)	<sup>21</sup> <sub>D</sub> 1.5582
51	H		p-OL	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.5492	32	H		-OH <sub>2</sub> OL(m, p混合)	<sup>21</sup> <sub>D</sub> 1.6034
52	H		p-OL	mp. 57~60°C	33	H		H	<sup>22</sup> <sub>D</sub> 1.5600
53	H		p-OL	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.5766	34	H		H	<sup>22</sup> <sub>D</sub> 1.5505
54	H		p-OL	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.6181	35	H		p-OL	mp. 100~101°C
55	H		p-OL	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.5598	36	H		p-OL	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.6029




























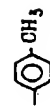






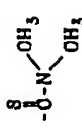




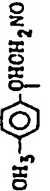
化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	X	物性値	化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	X	物性値
75	H		3-OCH <sub>3</sub> , 4-OH	mp. 83~87°C	56	H		4-Br	mp. 61~64°C
76	H		2,4-O <sub>2</sub>	<sup>25</sup> n <sub>D</sub> 1.6270	57	H		4-Br	mp. 71~73°C
77	H		3-NO <sub>2</sub>	mp. 50~53°C	58	H		4-Br	<sup>26</sup> n <sub>D</sub> 1.5827
78	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-OH	<sup>25</sup> n <sub>D</sub> 1.5498	59	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	4-Br	<sup>26</sup> n <sub>D</sub> 1.5943
79	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-OCH <sub>3</sub> , 4-OH	<sup>25</sup> n <sub>D</sub> 1.5477	60	H		4-Br	mp. 74~76°C
80	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4-O <sub>2</sub>	<sup>25</sup> n <sub>D</sub> 1.5627	61	H		4-Br	<sup>26</sup> n <sub>D</sub> 1.6307
81	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-NO <sub>2</sub>	<sup>25</sup> n <sub>D</sub> 1.5558	62	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Br	<sup>26</sup> n <sub>D</sub> 1.5636
82	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-OH	<sup>25</sup> n <sub>D</sub> 1.5643	63	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Br	<sup>26</sup> n <sub>D</sub> 1.5765
83	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-N(OH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	mp. 90~92°C	64	H		4-Br	<sup>26</sup> n <sub>D</sub> 1.5879
84	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-OCH <sub>3</sub> , 4-OH	<sup>25</sup> n <sub>D</sub> 1.5521	65	H		4-Br	mp. 135~137°C
85	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,4-O <sub>2</sub>	<sup>25</sup> n <sub>D</sub> 1.5674	66	H		4-Br	mp. 63~67°C
86	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-NO <sub>2</sub>	<sup>25</sup> n <sub>D</sub> 1.5660	67	H		4-O <sub>2</sub>	<sup>24</sup> n <sub>D</sub> 1.6004
87	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	3-OCH <sub>3</sub> , 4-OH	<sup>25</sup> n <sub>D</sub> 1.5794	68	H		4-O <sub>2</sub>	<sup>24</sup> n <sub>D</sub> 1.5937
88	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	2,4-O <sub>2</sub>	<sup>25</sup> n <sub>D</sub> 1.5998	69	H		H	<sup>27</sup> n <sub>D</sub> 1.6171
89	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	3-NO <sub>2</sub>	<sup>25</sup> n <sub>D</sub> 1.5955	70	H		H	<sup>27</sup> n <sub>D</sub> 1.6241
90	H		4-OH	mp. 115~117°C	71	H		4-O <sub>2</sub>	<sup>27</sup> n <sub>D</sub> 1.6387
91	H		4-N(OH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	mp. 90~93°C	72	H		4-O <sub>2</sub>	<sup>27</sup> n <sub>D</sub> 1.6307
92	H		3-OCH <sub>3</sub> , 4-OH	mp. 119~121°C	73	H		4-OH	mp. 120~123°C
93	H		2,4-O <sub>2</sub>	mp. 53~55°C	74	H		4-N(OH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	mp. 117~119°C

化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	X	物性値	化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	X	物性値
113	H		$\mu$ -OH	mp. 93~96°C	94	H		3-OCH <sub>3</sub> , $\mu$ -OH	mp. 70~73°C
114	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	$\mu$ -OL	<sup>24</sup> <sub>D</sub> 1.5426	95	H		2, $\mu$ -OL	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.6331
115	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> OH <sub>3</sub>	$\mu$ -OL	<sup>24</sup> <sub>D</sub> 1.5485	96	H		3-NO <sub>2</sub>	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.6309
116	OH <sub>3</sub>	-OH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	$\mu$ -OL	<sup>24</sup> <sub>D</sub> 1.5617	97	H		$\mu$ -OH	mp. 91~94°C
117	OH <sub>3</sub>		$\mu$ -OL	<sup>24</sup> <sub>D</sub> 1.6089	98	H		$\mu$ -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	mp. 83~87°C
118	OH <sub>3</sub>		$\mu$ -OL	<sup>24</sup> <sub>D</sub> 1.5991	99	H		3-OCH <sub>3</sub> , $\mu$ -OH	mp. 80~82°C
119	OH <sub>3</sub>		$\mu$ -OL	<sup>24</sup> <sub>D</sub> 1.5912	100	H		2, $\mu$ -OL	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.6091
120	H		3,5-Br, $\mu$ -OH	<sup>23</sup> <sub>D</sub> 1.6287	101	H		3-NO <sub>2</sub>	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.6092
121	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3,5-Br, $\mu$ -OH	<sup>23</sup> <sub>D</sub> 1.5816	102	H		$\mu$ -OH	mp. 130~132°C
122	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> OH <sub>3</sub>	3,5-Br, $\mu$ -OH	<sup>23</sup> <sub>D</sub> 1.5873	103	H		3-OCH <sub>3</sub> , $\mu$ -OH	mp. 93~97°C
123	H	-OH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	3,5-Br, $\mu$ -OH	<sup>23</sup> <sub>D</sub> 1.5945	104	H		2, $\mu$ -OL	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.5869
124	H		3,5-Br, $\mu$ -OH	<sup>23</sup> <sub>D</sub> 1.6374	105	H		3-NO <sub>2</sub>	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.5890
125	H		3,5-Br, $\mu$ -OH	mp. 89~91°C	106	H		$\mu$ -OH	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.6158
126	H		2-OH, 3-OCH <sub>3</sub>	<sup>23</sup> <sub>D</sub> 1.5948	107	H		$\mu$ -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	mp. 83~88°C
127	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-OH, 3-OCH <sub>3</sub>	<sup>23</sup> <sub>D</sub> 1.5505	108	H		2, $\mu$ -OL	mp. 92~94°C
128	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> OH <sub>3</sub>	2-OH, 3-OCH <sub>3</sub>	<sup>23</sup> <sub>D</sub> 1.5516	109	H		3-NO <sub>2</sub>	<sup>25</sup> <sub>D</sub> 1.6241
129	H	-OH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	2-OH, 3-OCH <sub>3</sub>	<sup>23</sup> <sub>D</sub> 1.5641	110	H		$\mu$ -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	mp. 163~167°C
130	H		2-OH, 3-OCH <sub>3</sub>	<sup>23</sup> <sub>D</sub> 1.5973	111	H		3-OCH <sub>3</sub> , $\mu$ -OH	mp. 160~163°C
131	H		2-OH, 3-OCH <sub>3</sub>	<sup>23</sup> <sub>D</sub> 1.6019	112	H		$\mu$ -OL	<sup>24</sup> <sub>D</sub> 1.5981

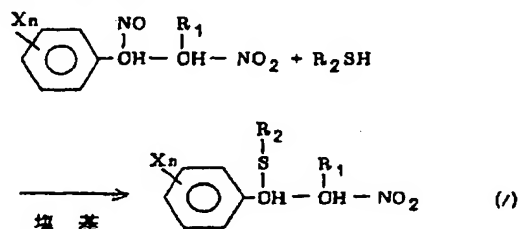
特開昭62-39563(7)

化合物No	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	X	物性値	化合物No	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	X	物性値
151	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-OL	<sup>21</sup> n <sub>D</sub> 1.5377	132	H		2-OH, 3-OCH <sub>3</sub>	<sup>25</sup> n <sub>D</sub> 1.5943
152	H	-OH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> OH <sub>3</sub>	3-OL	<sup>21</sup> n <sub>D</sub> 1.5681	133	H		4-CH <sub>3</sub>	mp. 70~72°C
153	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	3-OL	<sup>21</sup> n <sub>D</sub> 1.5732	134	H		4-CH <sub>3</sub>	mp. 67~69°C
154	H		3-OL	<sup>21</sup> n <sub>D</sub> 1.6375	135	H		3-OL	<sup>22</sup> n <sub>D</sub> 1.5986
155	H		3-OL	<sup>21</sup> n <sub>D</sub> 1.6220	136	H	-O(O <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>3</sub>	2,4-OL	mp. 70~72°C
156	H		3-OL	<sup>21</sup> n <sub>D</sub> 1.6034	137	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub>	<sup>22</sup> n <sub>D</sub> 1.5401
157	H		2-OH <sub>3</sub>	<sup>21</sup> n <sub>D</sub> 1.6037	138	H	-OH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>	<sup>22</sup> n <sub>D</sub> 1.5466
158	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-OH <sub>3</sub>	<sup>21</sup> n <sub>D</sub> 1.5432	139	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	4-CH <sub>3</sub>	<sup>22</sup> n <sub>D</sub> 1.5635
159	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-CH <sub>3</sub>	<sup>21</sup> n <sub>D</sub> 1.5482	140	H		4-CH <sub>3</sub>	<sup>22</sup> n <sub>D</sub> 1.6224
160	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	2-CH <sub>3</sub>	<sup>21</sup> n <sub>D</sub> 1.5645	141	H		4-CH <sub>3</sub>	<sup>22</sup> n <sub>D</sub> 1.6086
161	H		2-OH <sub>3</sub>	<sup>21</sup> n <sub>D</sub> 1.6249	142	H		4-CH <sub>3</sub>	mp. 53~58°C
162	H		2-OH <sub>3</sub>	<sup>21</sup> n <sub>D</sub> 1.6115	143	H		2,6-OL	<sup>23</sup> n <sub>D</sub> 1.6169
163	H		2-CH <sub>3</sub>	<sup>21</sup> n <sub>D</sub> 1.5962	144	H	-OH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,6-OL	<sup>22</sup> n <sub>D</sub> 1.5620
164	H		2-OH <sub>3</sub>	<sup>21</sup> n <sub>D</sub> 1.6192	145	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,6-OL	<sup>22</sup> n <sub>D</sub> 1.5716
165	H		2-CH <sub>3</sub>	<sup>21</sup> n <sub>D</sub> 1.5889	146	H	-OH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	2,6-OL	<sup>22</sup> n <sub>D</sub> 1.5852
166	H		2-OH <sub>3</sub>	<sup>22</sup> n <sub>D</sub> 1.6161	147	H		2,6-OL	<sup>22</sup> n <sub>D</sub> 1.6382
167	H		3-OL	<sup>22</sup> n <sub>D</sub> 1.6312	148	H		2,6-OL	<sup>22</sup> n <sub>D</sub> 1.6237
168	H		2,4-OL	<sup>21</sup> n <sub>D</sub> 1.6037	149	H		2,6-OL	<sup>22</sup> n <sub>D</sub> 1.6074
169	H		4-CH <sub>3</sub>	mp. 43~48°C	150	H		3-OL	<sup>21</sup> n <sub>D</sub> 1.6141

化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	X	物性値	化合物	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	X	物性値
189	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,5-OH <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5426	170	H		3-OH <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5997
190	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,5-OH <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5317	171	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-OH <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5401
191	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	2,5-OH <sub>3</sub>	mp. 40~43°C	172	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-OH <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5458
192	H		2,5-OH <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5948	173	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	3-OH <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5602
193	H		2,5-OH <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.6059	174	H		3-OH <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.6223
194	H		2,5-OH <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5918	175	H		3-OH <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.6063
195	H		2,5-OH <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.6172	176	H		3-OH <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5948
196	H		2,5-OH <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5996	177	H		3-OH <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.6161
197	H		2-OF <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5562	178	H		3-OH <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5944
198	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-OF <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5077	179	H		4-F	mp. 60~62°C
199	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-OF <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5110	180	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-F	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5333
200	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	2-OF <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5211	181	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-F	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5464
201	H		2-OF <sub>3</sub>	mp. 66~69°C	182	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	4-F	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5521
202	H		2-OF <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5306	183	H		4-F	mp. 40~42°C
203	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-OH <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5371	184	H		4-F	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.6036
204	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-OH <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5450	185	H		4-F	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5895
205	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	4-OH <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5372	186	H		4-F	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.6156
206	CH <sub>3</sub>		4-OH <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5941	187	H		4-F	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5911
207	H		4-OL	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.6119	188	H		2,5-OH <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.6043

化合物No	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	X	R <sub>2</sub>	X	物性値
208	H		2,4-O <sub>2</sub>			n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.6116
209	H		4-OH <sub>3</sub>			mp. 66~69°C
210	H		3-OCH <sub>3</sub> , 4-OH			mp. 108~110°C
211	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-NO <sub>2</sub>			n <sub>D</sub> <sup>16</sup> 1.5694
212	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> OH <sub>3</sub>	4-NO <sub>2</sub>			n <sub>D</sub> <sup>16</sup> 1.5800
213	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -n	4-O <sub>2</sub>			n <sub>D</sub> <sup>18</sup> 1.5443
214	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -n	2,4-O <sub>2</sub>			n <sub>D</sub> <sup>18</sup> 1.5516
215	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -n	4-F			n <sub>D</sub> <sup>18</sup> 1.5193
216	H		2,4-O <sub>2</sub>			n <sub>D</sub> <sup>18</sup> 1.6436
217	H		2,4-O <sub>2</sub>			mp. 90~93°C
218	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> OH <sub>3</sub>	2,3-O <sub>2</sub>			n <sub>D</sub> <sup>17</sup> 1.5730
219	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,3-O <sub>2</sub>			n <sub>D</sub> <sup>17</sup> 1.5651
220	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -n	2,3-O <sub>2</sub>			n <sub>D</sub> <sup>17</sup> 1.5522
221	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	2,3-O <sub>2</sub>			n <sub>D</sub> <sup>17</sup> 1.5836
222	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CO <sub>2</sub> OH <sub>3</sub>			n <sub>D</sub> <sup>17</sup> 1.5482
223	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-CO <sub>2</sub> H <sub>5</sub> , 4-OH			n <sub>D</sub> <sup>17</sup> 1.5474
224	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-OCH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>2</sub> - 			n <sub>D</sub> <sup>17</sup> 1.5782
225	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	4-O <sub>2</sub> OH <sub>3</sub>			n <sub>D</sub> <sup>17</sup> 1.5634
226	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	3-CO <sub>2</sub> H <sub>5</sub> , 4-OH			n <sub>D</sub> <sup>17</sup> 1.5637
227	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	3-OCH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>2</sub> - 			n <sub>D</sub> <sup>17</sup> 1.5918
228	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> OH <sub>3</sub>	3-OCH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>2</sub> - 			n <sub>D</sub> <sup>17</sup> 1.5831
229	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> OH <sub>3</sub>	2,4-O <sub>2</sub>			n <sub>D</sub> <sup>17</sup> 1.5714
230	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4-O <sub>2</sub>			n <sub>D</sub> <sup>17</sup> 1.5662
231	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	2,4-O <sub>2</sub>			n <sub>D</sub> <sup>17</sup> 1.5873
232	H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> O <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3,4,5-OCH <sub>3</sub>			mp. 68~70°C
233	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	3,4,5-OCH <sub>3</sub>			mp. 40~43°C
234	H		2,4-O <sub>2</sub>			n <sub>D</sub> <sup>15</sup> 1.6188
235	H		2,4-O <sub>2</sub>			mp. 127~129°C
236	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> ·H <sub>2</sub> O	4-O <sub>2</sub>			mp. 130~132°C
237	H		H			n <sub>D</sub> <sup>21</sup> 1.5570
238	H	-CH <sub>2</sub> OH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> - 	H			n <sub>D</sub> <sup>28</sup> 1.5805
239	H	-CH <sub>2</sub> OH <sub>2</sub> Si(O <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>3</sub>	H			n <sub>D</sub> <sup>26</sup> 1.4999
240	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> - 	H			n <sub>D</sub> <sup>22</sup> 1.5676
241	H		H			mp. 94~96°C
242	H		H			n <sub>D</sub> <sup>15</sup> 1.5839

本発明に従う一般式(I)で表わされるβ-ニトロフェニル誘導体は下記反応式(1)に示されるごとくβ-ニトロソニトロエタン類にメルカプタン類を反応させる新規な方法によつて容易に製造することができる。



本反応はエタノール、アセトニトリル、クロロホルムなどの極性溶媒中、トリエチルアミンまたはピリジンの触媒量添加により好適に進行する。反応温度は特に限定されないが、室温〜50℃が好ましく、0.5〜3時間で反応は完結する。

また本発明の化合物はつぎの反応式(2)に従うβ-ニトロステレン誘導体にメルカプタン類を付加せしめる既知の方法(たとえば特開昭52-

次いで溶媒を減圧留去し、淡黄色油状の標記化合物を得た。

収量28.6g(2-ニトロソ-2-フェニル-1-ニトロエタンに対する収率 99%) ;

$n_D^{22}$  1.6216

#### 実施例2

2-(ヒドロキシエチルチオ)-2-フェニル-1-ニトロエタン(化合物№5の化合物)の合成

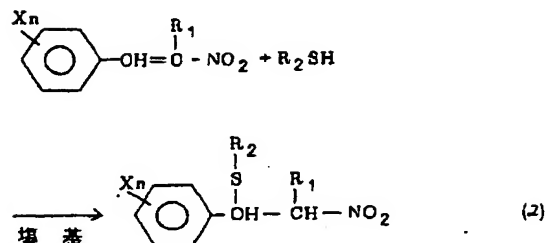
2-ニトロソ-2-フェニル-1-ニトロエタン90g(0.50モル)をアセトニトリル200mlに溶解し、メルカプトエタノール40g(0.51モル)を滴下した。続いてトリエチルアミンを3滴加え、40〜50℃にて20分間加熱撹拌した。冷却後、溶媒を減圧留去し、淡黄色油状の標記化合物を得た。

収量113g(収率 定量的) ;  $n_D^{25}$  1.5666

#### 実施例3

2-(o-クロルフェニル)-2-(メトキシカルボニルメチルチオ)-1-ニトロエタン(化

93730号公報)によつても合成することができる。



つぎに本発明の化合物の製造を代表的な実施例をあげてさらに説明する。

#### 実施例1

2-(p-クロルフェニルチオ)-2-フェニル-1-ニトロエタン(化合物№1の化合物)の合成

2-ニトロソ-2-フェニル-1-ニトロエタン18.0g(0.10モル)をアセトニトリル50mlに溶解し、p-クロルチオフェノール14.5g(0.10モル)を滴下、続いてピリジン2滴を加え、室温にて3時間撹拌した。

化合物№55の化合物)の合成

2-(o-クロルフェニル)-2-ニトロソ-1-ニトロエタン0.75g(0.0035モル)をアセトニトリル5mlに溶解し、チオグリコール酸メチルエステル0.38g(0.0035モル)を滴下、次いでトリエチルアミン1滴を加え、室温にて2.5時間撹拌後、実施例1に準じて処理し、淡黄色油状の標記化合物を得た。

収量1.0g(2-(o-クロルフェニル)-2-ニトロソ-1-ニトロエタンに対する収率 99%) ;  $n_D^{25}$  1.5598

#### 実施例4

1-(p-クロルフェニル)-1-(ヒドロキシエチルチオ)-2-ニトロプロパン(化合物№116の化合物)の合成

p-クロル-β-メチル-β-ニトロステレン2.00g(0.010モル)をメタノール10mlに溶解し、メルカプトエタノール0.78g(0.010モル)を滴下、続いてトリエチルアミン1滴を加え、30〜40℃にて10分間撹拌後2時間室温

下で撹拌した。次いで実施例1に従つて処理し、淡黄色油状の標記化合物を得た。

収量 2.7 g (p-クロル-β-メチル-β-ニトロステレンに対する収率 96%) ;  $n_D^{24}$  1.5617

#### 実施例3

2-(p-ブロムフェニルチオ)-2-(p-メチルフェニル)-1-ニトロエタン(化合物147の化合物)の合成

p-メチル-β-ニトロステレン 2.12 g (0.013モル)をアセトニトリル5mlに溶解、4-ブロムチオフェノール 2.46 g (0.013モル)およびトリエチルアミン1滴を滴下し、室温にて3時間撹拌した。次いで実施例1に従つて処理し、淡黄色油状の標記化合物を得た。

収量 4.3 g (p-メチル-β-ニトロステレンに対する収率 94%) ;  $n_D^{22}$  1.6224

一般式(I)で表わされる本発明の新規β-ニトロフェネチル誘導体は農園芸用殺菌剤として、既知の多くの農園芸用殺菌剤化合物と比較して優れた殺菌活性を示す。すなわち、本発明の化合物は、

禾穀類では、ムギ類の銹病、うどんこ病、イネおよびトリモロコシのごま葉枯病、イネのいもち病、豆類では大豆およびソラマメの銹病、インゲンマメの炭疽病、野菜類ではキュウリ、スイカ、ナス、ピーマンなどのうどんこ病、キュウリ、スイカ、メロンなどの炭疽病およびつる枯病、そしてネギの銹病などに有効である。また果樹園ではリンゴの赤星病、黒星病、うどんこ病、ナシの赤星病、黒星病、ブドウの銹病、晚腐病およびうどんこ病などに対して有効である。また本発明の化合物は強力な抗菌作用を有するが、有用植物に対する薬害はほとんどみられず、人畜毒性や魚毒性もなく安全に使用できる。

第2の本発明に従う農園芸用殺菌剤は、具体的には、前記一般式(I)の化合物をそのまま水または有機溶剤などの液体担体あるいは固体粉末担体その他適当な担体を用いて希釈し、必要に応じて湿潤剤、展着剤、分散剤、乳化剤、固着剤などの補助剤を加えて水和剤、油剤、液剤、乳剤、ゾル(フロアブル)剤、粒剤、DL(ドリフトレス)

種子消毒剤として使用した場合、ムギ類の黒穂病、なまぐさ黒穂病に消毒効果を示し、また特にイネごま葉枯病、イネ馬鹿苗病に対して優れた消毒効果を有する。またその他の植物病害に対しても防除効果を示す。たとえば

型粉剤、散粒剤、粉剤などに製剤化して使用すればよい。製剤化に際して使用される液体担体としては、たとえば、水、芳香族炭化水素類、脂肪族炭化水素類、アルコール類、エステル類、ケトン類、酸アミド類、ジメチルスルホキシドなどの溶剤が使用できる。また固体担体としては、クレータルク、カオリン、ベントナイト、珪藻土、炭酸カルシウム、珪酸などの鉱物質粉末、米粉その他の有機質粉末などがあげられる。また補助剤としては非イオン型、陰イオン型、陽イオン型および両性型の界面活性剤、リグニンスルホン酸またはその塩、ガム、脂肪族塩、メチルセルロースなどの糊類が使用できる。

水和剤、液剤および乳剤などの製剤は、活性成分を1~9.5重量%、通常は2~7.5重量%の範囲で含有し得る。これらの製剤は、水で希釈して一般に0.0001~10重量%で使用される。また粒剤、散粒剤および粉剤は、一般に0.1~10重量%の活性成分を含有する。また油剤、乳剤およびゾル剤(フロアブル剤)などの濃厚液は、希釈

することなくそのまま微量散布剤として使用できる。さらに種子消毒剤として使用するには、水和剤または粉剤をそのまま作物の種子に粉衣処理するか、または水和剤、ゾル剤、乳剤などを水で希釈して種子を浸漬処理することが効果的である。

また本発明の化合物を農園芸用殺菌剤として使用するに際しては、殺虫剤、殺菌剤、除草剤、植物生育調節剤などを混合して適用性の拡大をはかることができ、また場合によつては、これらの混用により、相乗効果を期待することもできる。

つきに本発明の農園芸用殺菌剤の製剤化の具体例を実施例によつて説明するが、本発明はこれらの実施例に限定されるものではない。なお、実施例中部とあるのはすべて重量部を示す。

#### 実施例 6 水和剤

化合物 6 16 の化合物 20 部、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル 5 部、リグニンスルホン酸カルシウム 3 部および珪藻土 7.2 部を均一に粉碎混合して、活性成分 20% を含む水和剤を得る。

#### 実施例 11 粒 剤

化合物 6 19 の化合物 3 部、リグニンスルホン酸カルシウム 1 部、ペントナイト 3.0 部およびクレー 6.6 部を均一に混合粉碎し、水を加えて造粒し、乾燥した後篩別して活性成分 3% を含む粒剤を得る。

つきに本発明化合物の農園芸用殺菌剤としての有用性、作用効果の具体例を試験例 1 および 2 に示す。

#### 試験例 1 イネ馬鹿苗病種子消毒効果試験

イネ（品質：近畿 33 号）の開花期にイネ馬鹿苗病菌（フザリウム・モニリホルム）の濃厚孢子懸濁液を噴霧接種して得たイネ馬鹿苗病菌感染粒を供試粒とした。種子消毒は、実施例 6 に準じて調製した水和剤を用いて所定濃度の希釈液を作成し、上記粒と懸液量比（v/v）を 1 対 1 として、20℃ で 24 時間浸漬消毒した。消毒後の粒は、20℃ で 3 日間浸漬した後、30℃ で 24 時間催芽させ、鳩胸状になつた粒を箱育苗法に準じてクミアイ粒状培土（興羽化学工業株式会社製）に

#### 実施例 7 乳 剤

化合物 6 46 の化合物 30 部、キシレン 50 部およびポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル 20 部を均一に溶解混合して、活性成分 30% を含む乳剤を得る。

#### 実施例 8 油 剤

化合物 6 48 の化合物 50 部とエチルセロソルブ 50 部とを均一に溶解混合して、活性成分 50% を含む油剤を得る。

#### 実施例 9 ゾル剤（フロアブル剤）

10μ 以下に粉碎した化合物 6 56 の化合物 40 部、ラウリルサルフェート 2 部、アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム 2 部、ヒドロキシプロピルセルロース 1 部および水 55 部を均一に混合して活性成分 40% を含むゾル剤を得る。

#### 実施例 10 粉 剤

化合物 6 89 の化合物 1 部、無水珪酸微粉末 0.5 部、ステアリン酸カルシウム 0.5 部、クレー 50 部およびタルク 48 部を均一に混合粉碎して活性成分 1% を含む粉剤を得る。

播種した。その後はガラス温室で栽培管理した。

発病調査は、播種 25 日後（4 葉期）に各処理区全苗をぬきとり、イネ馬鹿苗病発病苗数を調査して発病苗率(%)を求め、これより防除価(%)を算出した。本試験は、1 区 3 連制で行ない、平均種子消毒率(%)を求めた。またイネに対する被害を下記の指標により調査した。その結果は第 2 表のとおりである。

$$\text{発病苗率}(\%) = \frac{\text{発病苗数}}{\text{調査苗数}} \times 100$$

$$\text{種子消毒率}(\%) = \left( 1 - \frac{\text{処理区の発病苗率}}{\text{無処理区の発病苗率}} \right) \times 100$$

#### 被害の調査指標

5 : 激甚 4 : 甚 3 : 多 2 : 若干 1 : わずか 0 : なし



第 2 表

化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	被害程度	化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	被害程度
1	1000	100	0	21	1000	100	0
2	"	"	0	23	"	"	0
3	"	92	0	24	"	"	0
4	"	94	0	25	"	"	0
5	"	100	0	26	"	"	0
6	"	99	0	27	"	"	0
7	"	100	0	28	"	"	0
8	"	"	0	29	"	76	0
9	"	94	0	30	"	100	0
10	"	100	0	31	"	"	0
11	"	"	0	32	"	96	0
12	"	"	0	33	"	100	0
13	"	"	0	34	"	"	0
14	"	"	0	35	"	"	0
15	"	"	0	36	"	"	0
16	"	"	0	37	"	"	0
17	"	"	0	38	"	"	0
18	"	"	0	39	"	"	0
19	"	"	0	40	"	"	0
20	"	"	0	41	"	"	0
21	"	"	0	42	"	"	0
				43	"	"	0

化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	被害程度	化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	被害程度
44	1000	100	0	66	1000	100	0
45	"	"	0	67	"	"	0
46	"	"	0	68	"	"	0
47	"	"	0	69	"	"	0
48	"	"	0	70	"	"	0
49	"	"	0	71	"	"	0
50	"	"	0	72	"	"	0
51	"	"	0	73	"	"	0
52	"	"	0	74	"	"	0
53	"	"	0	75	"	"	0
54	"	"	0	76	"	"	0
55	"	"	0	77	"	"	0
56	"	"	0	78	"	"	0
57	"	"	0	79	"	"	0
58	"	"	0	80	"	"	0
59	"	"	0	81	"	"	0
60	"	"	0	82	"	"	0
61	"	"	0	83	"	"	0
62	"	"	0	84	"	"	0
63	"	"	0	85	"	"	0
64	"	"	0	86	"	"	0
65	"	"	0	87	"	"	0

化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	葉害程度
88	1000	100	0
89	"	"	0
90	"	"	0
91	"	99	0
92	"	100	0
93	"	"	0
94	"	"	0
95	"	"	0
96	"	"	0
97	"	"	0
98	"	"	0
99	"	"	0
100	"	"	0
101	"	"	0
102	"	"	0
103	"	"	0
104	"	"	0
105	"	"	0
106	"	"	0
107	"	"	0
108	"	"	0
109	"	"	0

化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	葉害程度
110	1000	100	0
111	"	"	0
112	"	"	0
113	"	"	0
114	"	"	0
115	"	70	0
116	"	100	0
117	"	"	0
118	"	"	0
119	"	"	0
120	"	72	0
121	"	74	0
122	"	100	0
123	"	78	0
124	"	81	0
125	"	89	0
126	"	100	0
127	"	"	0
128	"	"	0
129	"	"	0
130	"	"	0
131	"	"	0

化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	葉害程度
132	1000	100	0
133	"	"	0
134	"	"	0
135	"	"	0
136	"	"	0
137	"	"	0
138	"	"	0
139	"	"	0
140	"	"	0
141	"	"	0
142	"	"	0
143	"	"	0
144	"	"	0
145	"	"	0
146	"	"	0
147	"	"	0
148	"	"	0
149	"	"	0
150	"	"	0
151	"	"	0
152	"	"	0
153	"	"	0

化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	葉害程度
154	1000	100	0
155	"	"	0
156	"	"	0
157	"	"	0
158	"	"	0
159	"	"	0
160	"	"	0
161	"	"	0
162	"	"	0
163	"	"	0
164	"	"	0
165	"	"	0
166	"	"	0
167	"	"	0
168	"	"	0
169	"	"	0
170	"	"	0
171	"	98	0
172	"	100	0
173	"	"	0
174	"	"	0
175	"	"	0

化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	被害程度
176	1000	100	0
177	"	"	0
178	"	"	0
179	"	"	0
180	"	"	0
181	"	"	0
182	"	"	0
183	"	"	0
184	"	"	0
185	"	"	0
186	"	"	0
187	"	"	0
188	"	"	0
189	"	"	0
190	"	"	0
191	"	"	0
192	"	"	0
193	"	"	0
194	"	"	0
195	"	"	0
196	"	"	0
197	"	"	0

化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	被害程度
198	1000	100	0
199	"	79	0
200	"	100	0
201	"	93	0
202	"	100	0
203	"	"	0
204	"	"	0
205	"	"	0
206	"	"	0
207	"	"	0
208	"	"	0
209	"	"	0
210	"	"	0
211	"	"	0
212	"	"	0
213	"	"	0
214	"	"	0
215	"	"	0
216	"	"	0
217	"	"	0
218	"	"	0
219	"	"	0

化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	被害程度
220	1000	100	0
221	"	"	0
222	"	"	0
223	"	"	0
224	"	81	0
225	"	100	0
226	"	89	0
227	"	100	0
228	"	87	0
229	"	100	0
230	"	"	0
231	"	"	0
232	"	"	0
233	"	"	0
234	"	"	0
235	"	"	0
236	"	"	0
237	"	92	0
238	"	100	0
239	"	"	0
240	"	"	0
241	"	"	0

化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	被害程度
242	1000	99	0
比較薬剤田 (ベノミル)	"	92	
無処理区	-	発病苗率 64%	

(注) 市販薬剤ベノミル〔メチル 1 -  
(フタルカルバモイル) - 2 - ペン  
ズイミダゾール カーバメイト〕を  
示す。

## 試験例 2 イネごま葉枯病種子消毒効果試験

イネごま葉枯病多発性場で、自然感染したイネごま葉枯病菌(コクリオバルス・ミヤベアヌス)感染根を採集して、供試根とした。種子消毒法およびその他操作手順は試験例1と同様に行なった。発病調査は、播種20日後に行ない、イネごま葉枯病発病苗数を調査し、イネ馬鹿苗病種子消毒効果試験の場合と同様にして種子消毒率(%)を算出した。また試験例1と同一の基準により葉害を調査した。

本試験は、1区3連制で行ない、平均種子消毒率(%)を求めた。その結果は第3表のとおりである。

第 3 表

化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	葉害程度
1	1000	100	0
2	"	85	0
3	"	100	0
4	"	79	0
5	"	100	0
6	"	75	0
7	"	100	0
8	"	"	0
9	"	89	0
10	"	90	0
11	"	100	0
12	"	"	0
13	"	"	0
14	"	"	0
15	"	"	0
16	"	"	0
17	"	93	0
18	"	100	0
19	"	"	0
20	"	"	0
21	"	"	0

化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	葉害程度
22	1000	100	0
23	"	96	0
24	"	100	0
25	"	"	0
26	"	83	0
27	"	100	0
28	"	"	0
29	"	"	0
30	"	"	0
31	"	"	0
32	"	"	0
33	"	"	0
34	"	"	0
35	"	"	0
36	"	"	0
37	"	"	0
38	"	"	0
39	"	"	0
40	"	"	0
41	"	"	0
42	"	"	0
43	"	"	0

化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	葉害程度
44	1000	100	0
45	"	"	0
46	"	"	0
47	"	"	0
48	"	"	0
49	"	"	0
50	"	"	0
51	"	"	0
52	"	"	0
53	"	"	0
54	"	"	0
55	"	"	0
56	"	"	0
57	"	"	0
58	"	"	0
59	"	"	0
60	"	"	0
61	"	"	0
62	"	"	0
63	"	"	0
64	"	"	0
65	"	"	0

化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	薬害程度	化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	薬害程度
66	1000	100	0	88	1000	100	0
67	"	"	0	89	"	"	0
68	"	"	0	90	"	"	0
69	"	"	0	91	"	"	0
70	"	"	0	92	"	"	0
71	"	"	0	93	"	"	0
72	"	"	0	94	"	"	0
73	"	"	0	95	"	"	0
74	"	"	0	96	"	"	0
75	"	"	0	97	"	"	0
76	"	"	0	98	"	"	0
77	"	"	0	99	"	"	0
78	"	"	0	100	"	"	0
79	"	"	0	101	"	"	0
80	"	"	0	102	"	"	0
81	"	"	0	103	"	"	0
82	"	"	0	104	"	"	0
83	"	"	0	105	"	"	0
84	"	"	0	106	"	"	0
85	"	"	0	107	"	"	0
86	"	"	0	108	"	"	0
87	"	"	0	109	"	"	0

化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	薬害程度	化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	薬害程度
110	1000	100	0	132	1000	100	0
111	"	"	0	133	"	"	0
112	"	"	0	134	"	"	0
113	"	"	0	135	"	"	0
114	"	"	0	136	"	"	0
115	"	"	0	137	"	"	0
116	"	"	0	138	"	"	0
117	"	"	0	139	"	"	0
118	"	"	0	140	"	"	0
119	"	"	0	141	"	"	0
120	"	89	0	142	"	"	0
121	"	94	0	143	"	"	0
122	"	100	0	144	"	"	0
123	"	"	0	145	"	"	0
124	"	"	0	146	"	"	0
125	"	"	0	147	"	"	0
126	"	"	0	148	"	"	0
127	"	"	0	149	"	"	0
128	"	"	0	150	"	"	0
129	"	"	0	151	"	"	0
130	"	"	0	152	"	"	0
131	"	"	0	153	"	"	0

化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	被害程度
154	1000	100	0
155	"	"	0
156	"	"	0
157	"	"	0
158	"	"	0
159	"	"	0
160	"	"	0
161	"	"	0
162	"	"	0
163	"	"	0
164	"	"	0
165	"	"	0
166	"	"	0
167	"	"	0
168	"	"	0
169	"	"	0
170	"	"	0
171	"	"	0
172	"	"	0
173	"	"	0
174	"	"	0
175	"	"	0

化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	被害程度
176	1000	100	0
177	"	"	0
178	"	"	0
179	"	"	0
180	"	"	0
181	"	"	0
182	"	"	0
183	"	"	0
184	"	"	0
185	"	"	0
186	"	"	0
187	"	"	0
188	"	"	0
189	"	"	0
190	"	"	0
191	"	"	0
192	"	"	0
193	"	"	0
194	"	"	0
195	"	"	0
196	"	"	0
197	"	"	0

化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	被害程度
198	1000	100	0
199	"	"	0
200	"	"	0
201	"	"	0
202	"	"	0
203	"	"	0
204	"	"	0
205	"	"	0
206	"	"	0
207	"	"	0
208	"	"	0
209	"	"	0
210	"	"	0
211	"	"	0
212	"	"	0
213	"	"	0
214	"	"	0
215	"	"	0
216	"	"	0
217	"	"	0
218	"	"	0
219	"	"	0

化合物No	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	被害程度
220	1000	100	0
221	"	"	0
222	"	"	0
223	"	"	0
224	"	"	0
225	"	"	0
226	"	"	0
227	"	"	0
228	"	"	0
229	"	"	0
230	"	"	0
231	"	"	0
232	"	"	0
233	"	"	0
234	"	"	0
235	"	"	0
236	"	"	0
237	"	94	0
238	"	88	0
239	"	77	0
240	"	100	0
241	"	"	0

化合物名	処理濃度 (ppm)	種子消毒率(%)	被害程度
242	1000	100	0
比較薬剤田 (イプロジオン)	.	95	
無処理区		発病苗率45%	

(注) 市販薬剤イプロジオン〔3-(3,5-ジクロロフェニル)-N-イソプロピル-2,4-ジオキサイミダゾリジン-1-カルボキサミド〕を示す。

## 第1頁の続き

⑤Int. Cl.<sup>4</sup>

C 07 C 149/273  
154/00  
161/00  
C 07 D 239/38  
C 07 F 7/18

識別記号

庁内整理番号

Z-7188-4H  
7419-4H  
7419-4H  
7166-4C  
8018-4H

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**



**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

**BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☐ FADED TEXT OR DRAWING
- ☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☒ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**